

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2005年4月21日 (21.04.2005)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2005/035493 A1(51) 国際特許分類<sup>7</sup>: C07D 207/10,  
C07C 237/44, 271/28, 269/06, 269/04

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/015186

(22) 国際出願日: 2004年10月7日 (07.10.2004)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願2003-349318 2003年10月8日 (08.10.2003) JP  
特願2003-350441 2003年10月9日 (09.10.2003) JP  
特願2003-350439 2003年10月9日 (09.10.2003) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 帝人ファーマ株式会社 (TEIJIN PHARMA LIMITED) [JP/JP]; 〒1000011 東京都千代田区内幸町二丁目1番1号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 竹安 巧 (TAKEYASU, Takumi) [JP/JP]; 〒7400014 山口県岩国市日の出町2番1号 帝人ファーマ株式会社 岩国研究センター内 Yamaguchi (JP). 佐藤 嘉紀 (SATO, Yoshinori) [JP/JP]; 〒7400014 山口県岩国市日の出町2番1号 帝人ファーマ株式会社 岩国研究センター内 Yamaguchi (JP). 今井 穰 (IMAI, Minoru) [JP/JP]; 〒1000011 東京都千代田区内幸町二丁目1番1号 帝人ファーマ株式会社内 Tokyo (JP). 酒井 満 (SAKAI, Mitsuru) [JP/JP]; 〒1910065 東京都日野市旭が丘四丁目3番2号 帝人ファーマ株式会社 東京研究センター内 Tokyo (JP). 真鍋 健次 (MANABE, Kenji) [JP/JP]; 〒1910065 東京都日野市旭が丘一丁目13番

6号 Tokyo (JP). 松本 由之 (MATSUMOTO, Yoshiyuki) [JP/JP]; 〒1910065 東京都日野市旭が丘四丁目3番2号 帝人ファーマ株式会社 東京研究センター内 Tokyo (JP). 竹内 進 (TAKEUCHI, Susumu) [JP/JP]; 〒1910065 東京都日野市旭が丘四丁目3番2号 帝人ファーマ株式会社 東京研究センター内 Tokyo (JP). 河名 旭 (KAWANA, Asahi) [JP/JP]; 〒7400014 山口県岩国市日の出町2番1号 帝人ファーマ株式会社 岩国研究センター内 Yamaguchi (JP). 古賀 政博 (KOGA, Masahiro) [JP/JP]; 〒1910065 東京都日野市旭が丘四丁目3番2号 帝人ファーマ株式会社 東京研究センター内 Tokyo (JP). 朝日田 光晴 (ASAHITA, Mitsuharu) [JP/JP]; 〒4000124 山梨県甲斐市中下条1117-1-C202 Yamanashi (JP).

(74) 代理人: 三原 秀子 (MIHARA, Hideko); 〒1000011 東京都千代田区内幸町二丁目1番1号 株式会社帝人知財財産センター内 Tokyo (JP).

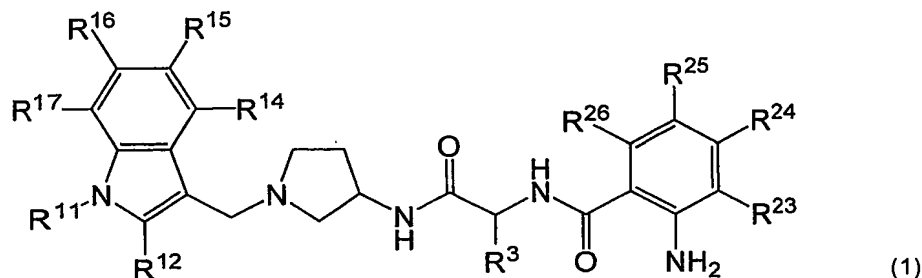
(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG,

[続葉有]

(54) Title: PROCESS FOR PRODUCING AMINOPYRROLIDINE DERIVATIVE AND INTERMEDIATE COMPOUND

(54) 発明の名称: アミノピロリジン誘導体の製造方法および中間体化合物



(1)

(57) Abstract: A process for industrially producing an aminopyrrolidine derivative represented by the following formula, which has antagonistic activity against a chemokine receptor; an intermediate; and a process for producing the intermediate. (I) (R<sup>11</sup> is hydrogen, C<sub>1-6</sub> alkyl, or C<sub>2-7</sub> alkanoyl; R<sup>12</sup>, R<sup>14</sup>, R<sup>15</sup>, R<sup>16</sup>, and R<sup>17</sup> each is hydrogen, halogeno, optionally halogenated C<sub>1-6</sub> alkyl, optionally halogenated C<sub>1-6</sub> alkoxy, hydroxy, or C<sub>2-7</sub> alkoxycarbonyl; R<sup>23</sup>, R<sup>24</sup>, R<sup>25</sup>, and R<sup>26</sup> each is hydrogen, halogeno, optionally halogenated C<sub>1-6</sub> alkyl, optionally halogenated C<sub>1-6</sub> alkoxy, or hydroxy; and R<sup>3</sup> is hydrogen or C<sub>1-6</sub> alkyl.)

[続葉有]

WO 2005/035493 A1



CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE,  
IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF,  
BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN,  
TD, TG).

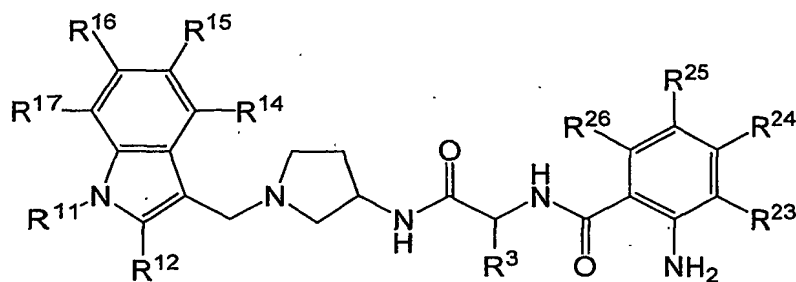
2文字コード及び他の略語については、定期発行される  
各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語  
のガイダンスノート」を参照。

添付公開書類:

— 国際調査報告書

(57) 要約:

下記式で表されるケモカイン受容体拮抗作用を有するアミノピロリジン誘導体の工業的製造方法、その製造中間体とその製造方法。



$R^{11}$ はH、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{2-7}$ アルカノイル； $R^{12}$ 、 $R^{14}$ 、 $R^{15}$ 、 $R^{16}$ 、 $R^{17}$ はH、ハロゲン、ハロゲンで置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル、ハロゲンで置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ、ヒドロキシ、 $C_{2-7}$ アルコキシカルボニル； $R^{23}$ 、 $R^{24}$ 、 $R^{25}$ 、 $R^{26}$ はH、ハロゲン、ハロゲンで置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル、ハロゲンで置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ、ヒドロキシ； $R^3$ はH、 $C_{1-6}$ アルキル。